

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年8月18日 (18.08.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/075475 A1

(51)国際特許分類: C07D 471/04, A61K 31/4375, 31/5377, 31/541, A61P 31/12, 31/18, 43/00 (74)代理人: 山内秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒5530002大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(21)国際出願番号: PCT/JP2005/001454

(22)国際出願日: 2005年2月2日 (02.02.2005)

(25)国際出願の言語: 日本語

(26)国際公開の言語: 日本語

(30)優先権データ:  
特願2004-027849 2004年2月4日 (04.02.2004) JP

(71)出願人(米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka (JP).

(72)発明者; および

(75)発明者/出願人(米国についてのみ): 大司照彦 (TAISHI, Teruhiko) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 多田幸男 (TADA, Yukio) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鶯洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(81)指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84)指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

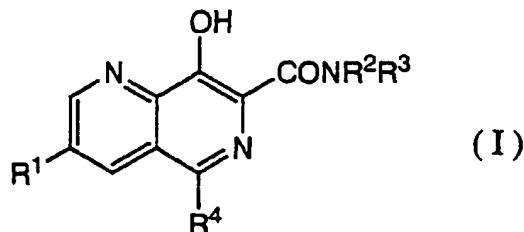
添付公開書類:  
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(54)Title: NAPHTHYLIDINE DERIVATIVE HAVING HIV INTEGRASE INHIBITORY ACTIVITY

(54)発明の名称: HIVインテグラーゼ阻害活性を有するナフチリジン誘導体

WO 2005/075475 A1



noncyclic groups); and R<sup>4</sup> is hydrogen, optionally substituted carboxy, etc.] or a salt thereof.

(57)Abstract: [PROBLEMS] To provide a novel compound having antiviral activity, especially HIV integrase inhibitory activity; and a medicine, in particular, an anti-HIV drug, which contains the compound. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] The compound is one represented by the formula (I) [wherein R<sup>1</sup> is optionally substituted aralkyl; R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> each independently is hydrogen, optionally substituted alkyl, etc. (provided that the substituent(s) with which the alkyl is "optionally substituted" are

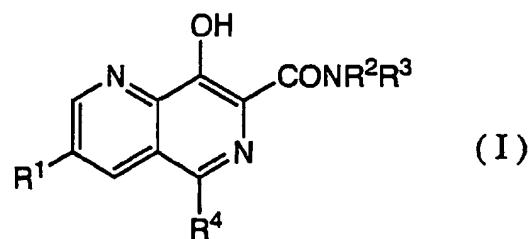
有機葉有)



## (57) 要約:

【課題】抗ウイルス作用、特にHIVインテグラーゼ阻害活性を有する新規化合物及びそれを含有する医薬、特に抗HIV薬を提供する。

【解決手段】式：



(式中、R<sup>1</sup>は、置換されていてもよいアラルキル；R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、それぞれ独立して、水素、置換されていてもよいアルキル等（但し、「置換されていてもよい」に係る各置換基は非環式基である）；R<sup>4</sup>は、水素、置換されていてもよいカルボキシ等）で示される化合物またはその塩。